

⑬ 日本国特許庁 (JP)

⑩ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報 (A)

昭55—124763

⑪ Int. Cl.<sup>3</sup>  
C 07 D 213/64  
213/70

識別記号 庁内整理番号  
7138—4C  
7138—4C

⑬ 公開 昭和35年(1960)9月26日

発明の数 1  
審査請求 未請求

(全 3 頁)

④ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体

⑪ 特 願 昭54—32068

⑫ 出 願 昭54(1979)3月19日

⑫ 発 明 者 西山隆三  
高槻市真上町5丁目41番22号

⑫ 発 明 者 藤川政一  
守山市浮気町321番地の31

⑫ 発 明 者 横道勲  
草津市野村町221番地

⑫ 発 明 者 芳賀隆弘

草津市野村町221番地

⑫ 発 明 者 長谷邦昭

守山市浮気町321番地の31

⑫ 発 明 者 林弘仁

守山市浮気町321番地の31

⑫ 出 願 人 石原産業株式会社

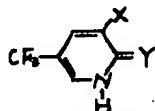
大阪市西区江戸堀1丁目3番11号

## 明 細 書

1. 発明の名称 5-トリフルオロメチル-2-  
ピリドン誘導体

2. 特許請求の範囲

1. 一般式

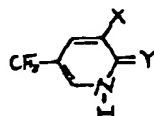


(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体。

3. 発明の詳細な説明

本発明は医薬、農薬、染料などの中間原料として有用で、新規な5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体に関する。

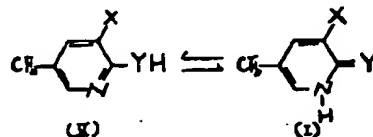
詳しくは本発明は一般式



(I)

(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

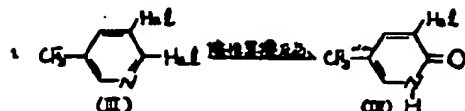
前記一般式(I)の5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性として存在することができる。



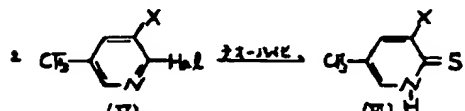
(式中X及びYは前述の通りである)

前記一般式(I)において、Xで表わされるハロゲン原子としては弗素、塩素、臭素、碘素が挙げられる。

本発明の5-トリフルオロメチル-2-ビリ  
ドン誘導体は通常、例えば下記方法によって製  
造される。



(上記反応式中 Hald はハロゲン原子である)  
一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジ  
メチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶  
媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなど  
のアルカリ水溶液を用いて50〜150℃、0.1  
〜10時間で行なわれる。



(上記反応式中 X 及び Hald は前述の通りで  
ある)

一般に上記反応はメタノール、エタノールな  
どのアルコール類、ジメチルスルホキシド、ジ  
メチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶

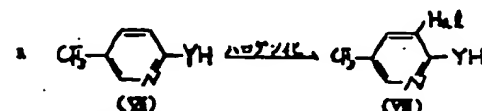
- 3 -

媒とを反応させることによりN-ベンゾイ  
ル-N'-[4-(5-トリフルオロメチルビリ  
ジン-2-イルオキシ)フェニル]ウレア系化  
合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の3  
-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ビリ  
ドンと3,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを  
縮合、還元して3,5-ジクロロ-4-(3-ク  
ロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-  
イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと2  
,6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを  
反応させると、N-(2,6-ジフルオロベン  
ゾイル)-N'-[3,5-ジクロロ-4-(3-ク  
ロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-  
イルオキシ)フェニル]ウレアを得ることがで  
きる。このものは殺虫剤の有効成分として優れた  
活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆虫の  
防除に有効であって、例えばこの化合物100  
ppm水分散液にキャベツの葉片を浸漬し、それ  
を風乾してそこに2〜3頭のコナガの幼虫を放  
ち、8日に生死を判定した結果、100%の

- 5 -

H隆昭55-124763(2)

死などの誘導中、チオ尿素、酸化ソーダ、チオ  
硫酸ソーダ、N,N-ジメチルジチオカルバミ  
ン酸ソーダなどのチオール化剤を用いて50〜  
室温温度0.5〜10時間で行なわれる。



(上記反応式中 Y 及び Hald は前述の通りである)

一般に上記反応は四塩化炭素、クロロホルム、  
酢酸、二硫化炭素、水、非プロトン性極性溶媒  
などの溶媒中、塩素ガス、臭素、チオニクロ  
ライド、スルフィルクロライドなどのハロゲン  
化剤を用いて0〜100℃、0.5〜10時間で行  
なわれる。

本発明化合物は、例えばハロゲン化ニトロベ  
ンゼン類と縮合させて4-(5-トリフルオロ  
メチルビリジン-2-イルオキシ)ニトロベ  
ンゼン類を生成させ、これを還元して得られる4  
-(5-トリフルオロメチルビリジン-2-イ  
ルオキシ)アニリン類とベンゾイルイソシア

- 4 -

死虫率が得られた。

次に本発明化合物の具体的な合成例を記載する。

合成例1 3-クロロ-5-トリフルオロメチ  
ル-2-ビリドン

(A)

5-トリフルオロメチル-2-ビリドン0  
2gをクロロホルム20mlに溶解させ、50  
℃に加熱して塩素ガスを1時間攪拌下に通じ  
た。反応終了後、クロロホルムを蒸発し、ト  
ルエン-n-ヘキサンとの混合溶媒で再結晶し  
て融点144〜147℃の目的物0.15gを得た。

(B)

水酸化ナトリウム2.4gを水125mlに溶  
解させた水溶液に2,3-ジクロロ-5-トリ  
フルオロメチルビリジン4gを加え、更にジ  
メチルスルホキシド25mlを加えて加熱し、  
110℃で1時間攪拌下に反応させた。反応  
終了後生成物を蒸発し、最少量で酸性にして  
沈殿物を得、このものを過濾して目的物2.5

- 6 -

ヲを得た。

合成例 2 5-トリフルオロメチル-2-チオ  
ビリジン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルビリ  
ジン4gとチオ尿素1.67gとをエタノール  
30mlに溶解させ、加熱して還流状態で3時  
間攪拌下に反応させた。その後、水酸化カリ  
ウム水溶液1.23gを徐々に加えて還流状態  
で1時間反応させた。反応終了後、生成物を  
放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化  
メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次い  
で、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後  
無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレ  
ンを留去して融点147~150℃の目的物  
2.1gを得た。

合成例 3 3-ブロモ-5-トリフルオロメチ  
ル-2-ビリジン

5-トリフルオロメチル-2-ビリジン0.  
4gを酢酸10mlに溶解させ、そこへ臭素0.  
4gを加えて攪拌下で4時間反応させた。反

- 7 -

特許55-124763(3)

応終了後、酢酸を留去し、塩化メチレン-ロ  
-ヘキサンの混合溶液で再結晶して融点162  
~165℃の目的物0.45gを得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフルオロメチ  
ル-2-チオビリジン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルビリ  
ジン4gに代えて2,3-ジクロロ-5-トリ  
フルオロメチルビリジン4.75gを用いる以  
外は前記合成例2と同様にして反応を行ない、  
後処理を行なって融点125~128℃の目  
的物1.9gを得た。

特許出願人 石原産業株式会社

- 8 完 -